

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 59-027824
(43)Date of publication of application : 14.02.1984

(51)Int.Cl. A61K 31/575
// C07J 9/00

(21)Application number : 57-136535 (71)Applicant : SANKYO CO LTD
(22)Date of filing : 05.08.1982 (72)Inventor : KANEDA HISASHI
KIRIBUCHI MICHIAKI

(54) ANTILOPHEMIC AGENT

(57)Abstract:

PURPOSE: An antilopemic agent, containing trimethylsteroid as a main component, and capable of exhibiting cholesterol reducing action in blood equal to that of a vegetable sterol, e.g. β -sitosterol.

CONSTITUTION: An antilopemic agent containing trimethylsteroid, particularly preferably cycloartenol and 24-methylenecycloartanol, as a main component. A carrier or adjuvant is added to the above-mentioned compounds and formulated into an agent for the oral administration, e.g. a tablet, powder, capsule or syrup, etc. The daily dose thereof is 0.2W15g, preferably 0.5W5g for adults.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

⑯ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭59-27824

⑬ Int. Cl.³
A 61 K 31/575
// C 07 J 9/00

識別記号
ADN

府内整理番号
7169-4C
7043-4C

⑭ 公開 昭和59年(1984)2月14日
発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑮ 抗脂血剤

⑯ 特 願 昭57-136535

仙台市八幡1-3-21ドルミハ
幡704号

⑰ 出 願 昭57(1982)8月5日

⑯ 発明者 桐浦道明

特許法第30条第1項適用 昭和57年4月1日
発行日本栄養・食糧学会総会事務局の「第36
回日本栄養・食糧学会総会講演要旨集」にお
いて発表

東京都世田谷区宮坂1-44-25

立美庄207号

⑰ 発明者 金田尚志

⑯ 出願人 三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3丁目

1番地の6

⑯ 代理人 弁理士 横山庄治

明細書

1. 発明の名称

抗脂血剤

アル剤の $1/10$ 以下の投与量で同等の効果を有して
いることが知られている。(特開昭57-18617
号公報参照)。

2. 特許請求の範囲

しかし、トリメチルステロイドを含む大豆油
不ケン化物中のアルコール類には血中コレステ
ロール低下作用がないと報告されている(栄養
と食糧, 19巻, 438頁, 1968年)。本発明者
らはトリメチルステロイドについて、その血中
コレステロール低下作用を調べたところ、
 β -シトステロールなどの植物ステロールと同等の
効果を有することが判り、本発明を完成した。

1. トリメチルステロイドを主成分とする抗脂
血剤。
2. トリメチルステロイドがシクロアルテノー
ルまたは 24 -メチレンシクロアルタノール
である特許請求の範囲第1項記載の抗脂血剤。

本発明で用いられるトリメチルステロイドと
しては、シクロアルテノール、シクロラクデノ
ール、 24 -メチレンシクロアルタノール等を
挙げることができるが、シクロアルテノールお
よび 24 -メチレンシクロアルタノールが特に
好ましい。

3. 発明の詳細な説明

本発明は、トリメチルステロイドを主成分と
する抗脂血剤に関する。

β -シトステロールやカンペステロールなど
の植物ステロールは血清コレステロールを低下
させることが知られており、その作用機序は一
般に、腸管からのコレステロール吸收阻害と考
えられている。植物ステロールにその量の $1/10$
 $\sim 1/100$ のトリメチルステロイド、例えばシクロ
アルテノール、 24 -メチレンシクロアルタノール
などを添加して投与すると、通常の植物ステロ

アルテノールおよび 24 -メチレンシ
クロアルタノールの調製法は特開昭57-18617号
公報に記載されている。

第 1 表

(単位: %)

組成	群	1	2	3	4
カゼイン	22	22	22	22	22
セルロース	3	3	3	3	3
無機塩混合物	4	4	4	4	4
ビタミン混合物	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
塩化コリン	0.24	0.24	0.24	0.24	0.24
綿実油	5	5	5	5	5
胆汁酸塩		0.125	0.125	0.125	0.125
コレステロール		0.5	0.5	0.5	0.5
シクロアルテノール			1		
24-メチレンシクロアルタノール				1	
無糖	85.26	84.835	63.835	63.835	

第 2 表

群	血漿コレステロール, mg/dl	抑制率(%)
1	128.4±5.6	—
2	178.2±5.9	0
3	153.7±7.5 ^a	50.2
4	160.1±7.1 ^a	37.1

^a: 第 2 群に対しての有意差 P < 0.05

$$\text{抑制率} = \left(1 - \frac{\text{各群} - 1 \text{群}}{2 \text{群} - 1 \text{群}} \right) \times 100 (\%)$$

本結果によればシクロアルテノールまたは24-メチレンシクロアルタノールを飼料中に添加することにより血漿コレステロールが減少することは明らかである。

〔急性毒性〕

例えばシクロアルテノールをラットおよびマウスに 5g/kg 飼口投与しても、死亡しなかつた。

〔製剤例 1〕

シクロアルテノール 280 g、ビタミン D 10 g、クエン酸 5 g、緑茶葉グリコール酸カルシ

ウム 20 g、ラクリル硫酸ナトリウム 10 g、ポリオキシエチレンモノステアレート 5 g、メチレンクロライド 300 mlを取り、よく混合攪拌しケン滴液状とする。これにアエロジル 200 ~ 400 (商品名) 180 g 加えて混合攪拌後、50 ~ 60°Cで乾燥し、得られた塊状物を碎いて吸着末を得る。この吸着末にポリビニルビロリドン、2-メチル-5-ビニルビリジン-メタアクリル酸・アクリル酸メチルエチル共重合体のような有機溶媒可溶性結合剤 20 g を溶かしたクロロセン・エタノール浴液 300 mlを加え、練合後、常法に従いエツクペレツターで造粒、約 60°Cで乾燥すると粘着性のない固体化良好な顆粒を得る(活性成分約 5.1% 含有)。本品に少量のステアリン酸マグネシウム等の滑潤剤を加えることによりカプセル自動充填機で 200 mg 硬カプセルに充填することができる。

〔製剤例 2〕

24-メチレンシクロアルタノール 280 g をナタネ油 120 g に溶かし、常法に従つてソフト

カプセルに充填した。1カプセル 100 mgで活性成分 6.64 %含有。

[製剤例 3]

5.0 g ソルビトール水溶液 100 ml H D K エステル E 160 (商品名)とポリソルベート 80 2 g を溶かしこれにシクロアルテノール 5.0 g を乳化する。加え 80 °C で約 20 分間攪拌し乳化後、安息香酸ナトリウム 0.25 g、クエン酸 1 g を加えて溶かした後、蒸留水で全量 500 ml とし、再び攪拌して乳剤を得る。(活性成分を約 1.0 %含有)



特許出願人 三共株式会社

代理人 弁理士 梶出 庄治